

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年9月9日 (09.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/082874 A1(51) 国際特許分類: C07D 281/10, A61K 31/22,  
31/366, 31/38, 31/381, 31/395, 31/4025, 31/428, 31/439,  
31/4995, 31/5375, 31/541, 31/554, A61P 1/16, 3/04, 3/06,  
9/10, C07D 337/08, 409/12, 453/02, 471/08, 487/08

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/003686

(22) 国際出願日: 2005年2月25日 (25.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-128992 2004年2月27日 (27.02.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 旭化成  
ファーマ株式会社 (ASAHI KASEI PHARMA COR-  
PORATION) [JP/JP]; 〒1018481 東京都千代田区神田  
美土代町9番地1 Tokyo (JP).

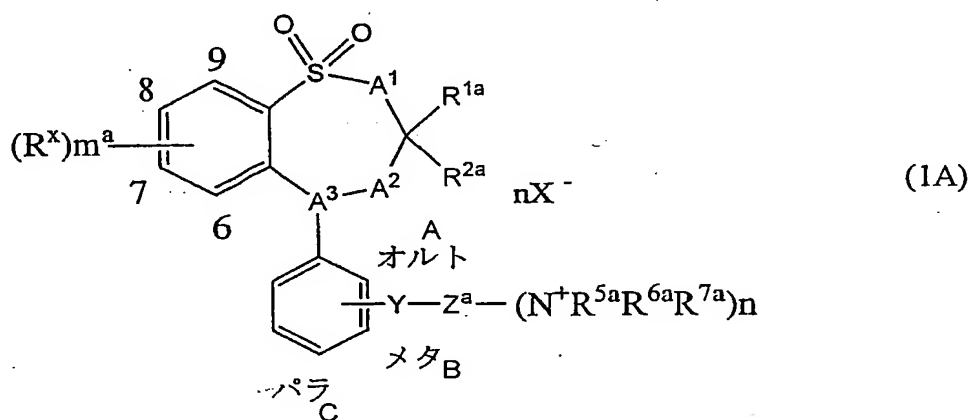
(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 笹原 剛彦  
(SASAHARA, Takehiko) [JP/JP]; 〒4100105 静岡県沼津市馬込95 Shizuoka (JP). 毛利 光伸 (MOHRI,  
Mitsunobu) [JP/JP]; 〒4110831 静岡県三島市東本町  
2-4-16 Shizuoka (JP). 笠原 憲一 (KASAHARA,  
Ken-ichi) [JP/JP]; 〒4102122 静岡県田方郡菰山町寺  
家134-1 Shizuoka (JP).(74) 代理人: 酒井 宏明 (SAKAI, Hiroaki); 〒1000013 東京  
都千代田区霞が関三丁目2番6号 東京倶楽部ビル  
ディング 酒井国際特許事務所 Tokyo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,

[続葉有])

(54) Title: NOVEL BENZOTHIAZEPINE AND BENZOTHIPIINE COMPOUNDS

(54) 発明の名称: 新規なベンゾチアゼピン及びベンゾチエピン化合物

A- ORTHO  
B- META  
C- PARA

(57) Abstract: It is intended to provide a drug useful as a remedy and a preventive for hyperlipemia; a drug also useful as a remedy and a preventive for liver disorders accompanying bile stasis, in particular, primary biliary cirrhosis, primary sclerotic cholangitis and so on; and a drug useful as a remedy and a preventive for obesity, fatty liver and fatty hepatitis. A benzothiazepine or benzothiopyne compound represented by the following general formula (1A) which has a thioamide bond and a quaternary ammonium substituent.

[続葉有])



SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

高脂血症治療及び予防剤等として有用な医薬、更には、胆汁うっ滞に伴う肝障害、特に原発性胆汁性肝硬変及び原発性硬化性胆管炎等の治療及び予防剤としても有用な医薬、更には、肥満、脂肪肝及び脂肪性肝炎の治療及び予防剤として有用な医薬を提供する。下記の式(1A)で表される、チオアミド結合及び4級アンモニウム置換基を有するベンゾチアゼピン又はベンゾチエピン化合物。

